



VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000055413	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP2005/002427	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 08.03.2005	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 10.03.2004
Internationale Patentklassifikation (IPC) oder nationale Klassifikation und IPC INV. C07D487/04 A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt 2 Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in elektronischer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Berichts</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 29.06.2005	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 28.04.2006	
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - Gitschiner Str. 103 D-10958 Berlin Tel. +49 30 25901 - 0 Fax: +49 30 25901 - 840	Bevollmächtigter Bediensteter Hass, C Tel. +49 30 25901-340 	

Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bescheid auf

- ☒ der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde.
- ☐ einer Übersetzung der internationalen Anmeldung in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 a) und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4 a))
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 a) und/oder 55.3 a))

2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt):*

Beschreibung, Seiten

1-23 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-10 eingegangen am 13.12.2005 mit Schreiben vom 12.12.2005

- ☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☒ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☒ Ansprüche: Nr. 4-6
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

- ☐ Beschreibung: Seite
- ☐ Ansprüche: Nr.
- ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
- ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
- ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/002427

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 1-10
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (IS)	Ja: Ansprüche 1-10
	Nein: Ansprüche
Gewerbliche Anwendbarkeit (IA)	Ja: Ansprüche: 1-10
	Nein: Ansprüche:

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

V.1 Zitierte Dokumente

- D1: EP-A-0 141 317 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 15. Mai 1985 (1985-05-15)
- D2: WO 03/009687 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT; TORMO I BLASCO, JORDI; SAUTER, HUBERT; MUELLE) 6. Februar 2003 (2003-02-06)
- D3: EP-A-0 215 382 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 25. März 1987 (1987-03-25)
- D4: GB-A-1 148 629 (VEB. DEUTSCHES HYDRIERWERK RODLEBEN) 16. April 1969 (1969-04-16)
- D5: EP-A-0 770 615 (AMERICAN CYANAMID COMPANY; BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 2. Mai 1997 (1997-05-02)
- D6: EP-A-0 614 113 (MITSUBISHI PAPER MILLS, LTD; MITSUBISHI PAPER MILLS LTD) 7. September 1994 (1994-09-07)

Die angegebenen Bezeichnungen gelten für das gesamte Prüfungsverfahren.

V.2 Neuheit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist vom Gegenstand der Ansprüche 1-6 des Dokuments D1 generisch umfasst. Es gibt aber in D1 keine konkreten Einzelverbindungen, die unter die vorliegenden Ansprüche fallen, da der Rest R^2 in D1 nur als CH_3 , $n-C_3H_7$ oder $n-C_4H_9$ verifiziert ist.

Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche unterscheidet sich von der Offenbarung in D2 durch die Definition der Gruppe R^2 , die der Gruppe X in D2 entspricht.

Der Gegenstand der vorliegenden Ansprüche unterscheidet sich von den in D3 offenbarten Verbindungen zumindest darin, dass dort der der Gruppe R^1 entsprechende Rest immer eine Arylgruppe trägt.

In den in D4 offenbarten Verbindungen hat die R^1 entsprechende Alkylgruppe nur maximal 4 C-Atome.

Von dem in D5 offenbarten Gegenstand sind die in der Anmeldung beanspruchten Zwischenprodukte der Formeln IV und V generisch umfasst. Bei den konkret in D5

genannten Verbindungen ist jedoch der der Gruppe R^1 entsprechende Rest Phenyl.
In D6 sind zwei Verbindungen offenbart, die sich von den Zwischenprodukten der Formel IV lediglich hinsichtlich des Restes R^2 unterscheiden.
Somit ist der Gegenstand aller vorliegenden Ansprüche neu.

V.3 Erfinderische Tätigkeit

V.3.1 Gemäß der Beschreibung ist die der Anmeldung zugrunde liegende Aufgabe darin zu sehen, 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine bereitzustellen, die den aus D1 bekannten ähnlichen Verbindungen in ihrer fungiziden Wirkung überlegen sind.

V.3.2 Relevanter Stand der Technik für den Gegenstand des Anspruchs 1 sind die Dokumente D1 bis D3, da sie fungizid wirksame 7-Amino-triazolopyrimidine offenbaren. Der strukturell nächste Stand der Technik ist D1, da es Verbindungen offenbart, die sich hinsichtlich der Gruppe R^2 von den nunmehr beanspruchten Verbindungen, die eine Ethyl-, Ethenyl- oder Allylgruppe tragen, darin unterscheiden, dass sie eine n-Propylgruppe oder eine n-Butylgruppe tragen (D1, Verbindungen 21, 23, 42 und 48). Generisch sind die anmeldungsgemäßen Verbindungen, die als R^2 -Gruppe Ethyl tragen, sogar von D1 umfasst (siehe D1, Seite 2, Zeilen 1-5).

V.3.3 Der Fachmann, der vor der oben definierten Aufgabe steht, würde sicherlich die allgemeine Offenbarung aus D1 zum Anlass nehmen, neue, aber innerhalb der generischen Offenbarung von D1 liegende Verbindungen herzustellen, wobei er davon ausgehen könnte, dass diese Verbindungen ebenfalls fungizide Eigenschaften hätten. Genau das ist im vorliegenden Fall getan worden, und somit ist es nicht überraschend, dass die anmeldungsgemäßen Verbindungen überhaupt fungizid wirken.

V.3.4 Die Anmelderin hat nun jedoch Versuche eingereicht, mit denen bestimmte anmeldungsgemäße Verbindungen mit den strukturnächsten Verbindungen aus D1 verglichen werden. Aus diesen Versuchen geht hervor, dass einige bevorzugte Ausführungsformen der anmeldungsgemäßen Verbindungen, nämlich die jetzt beanspruchten, bei denen R^2 bestimmte Bedeutungen hat, eine unerwartet höhere Wirksamkeit haben. Wird bei Verbindungen aus D1 für den Methylrest, der R^2 entspricht, Ethyl eingeführt, haben die so entstandenen Verbindungen eine wesentlich verbesserte

Wirksamkeit gegen Krautfäule an Tomaten. Auch der Ersatz von Propyl durch Allyl führt zu wesentlich verbesserter Wirkung. Anmeldungsgemäße Verbindungen, die die genannten Reste tragen, lösen daher die oben definierte Aufgabe in nicht naheliegender Weise. Ihnen kann daher erfinderische Tätigkeit zuerkannt werden.

V.3.5 Eine verbesserte Wirkung durch den Rest $R^2 = \text{Ethenyl}$ wurde nicht speziell gezeigt und ist daher zweifelhaft. Durch Einführung des Restes $R^2 = \text{Ethenyl}$ wurde daher eine Aufgabe gelöst, die von der oben definierten verschieden ist, nämlich lediglich die Bereitstellung **weiterer** (nicht notwendigerweise verbesserter) fungizid wirkender 5,6-Dialkyl-7-amino-triazolopyrimidine. Die Ethenyl-Derivate sind jedoch in D1 nicht offenbart und auch nicht nahegelegt, so dass auch diesen Verbindungen aufgrund ihrer nicht naheliegenden Struktur das Vorliegen erfinderischer Tätigkeit zuerkannt werden kann. Es wird aber betont, dass aufgrund der verschiedenen gelösten technischen Aufgaben *(Verbindungen mit $R^2 = \text{Ethyl}$ oder Allyl haben einen unerwarteten technischen Effekt, nämlich eine verbesserte Wirkung, Verbindungen mit $R^2 = \text{Ethenyl}$ haben eine nicht naheliegende Struktur und stellen damit weitere, vom Stand der Technik nicht nahegelegte Verbindungen dar)* den Ethyl- und Allylderivaten einerseits und den Ethenylderivaten andererseits zwei verschiedene erfinderische Konzepte zugrunde liegen, wodurch der Gegenstand der Ansprüche als **nicht einheitlich** bezeichnet werden muss.

V.3.6 Es bleibt festzuhalten, dass erfinderische Tätigkeit den Stoffansprüchen 1-4 und den verwendungsbezogenen Ansprüchen 8 bis 10 zuerkannt werden kann.

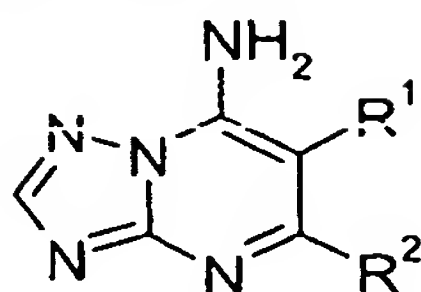
V.3.7 Die von den Verfahrensansprüchen 5 und 7 umfassten Verfahren sind den in D1 offenbarten analog; auch die von Anspruch 6 umfassten Zwischenprodukte sind analog denen aus D1. Den Ansprüchen 5 und 7 sowie 6 kann jedoch ebenfalls erfinderische Tätigkeit zuerkannt werden, da die beanspruchten Zwischenprodukte mit Hilfe der beanspruchten Verfahren zu erfinderischen Endprodukten umgesetzt werden.

V.4 Gewerbliche Anwendbarkeit

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 ist gewerblich anwendbar.

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I



5 in der die Substituenten folgende Bedeutung haben:

R¹ C₅-C₁₂-Alkyl oder C₅-C₁₄-Alkoxyalkyl, wobei die aliphatischen Gruppen durch eine bis drei der folgenden Gruppen substituiert sein können:

10 Cyano, Nitro, Hydroxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkylthio und NR^aR^b;

R^a, R^b Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl;

R² Ethyl, CH=CH₂ oder CH₂CH=CH₂.

15

2. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin R² Ethyl bedeutet.

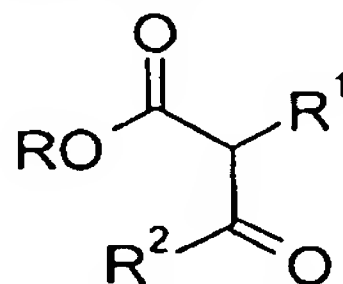
3. Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, worin R¹ für eine unsubstituierte unverzweigte oder ein-, zwei- oder dreifach verzweigte Alkylkette mit bis zu 12 Kohlenstoffatomen steht.

20

4. Triazolopyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1 ausgewählt aus:
 5-Ethyl-6-(1-methyl-heptyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Ethyl-6-octyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 25 5-Ethyl-6-(3,5,5-trimethyl-hexyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-yl-amin;
 5-Ethyl-6-pentyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Ethyl-6-hexyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Ethyl-6-heptyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Ethyl-6-nonyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 30 5-Ethyl-6-undecyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin;
 5-Ethyl-6-(3-pentyloxy-propyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamin.

30

5. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass man β-Ketoester der Formel II,

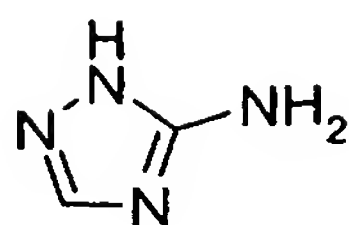


II

35

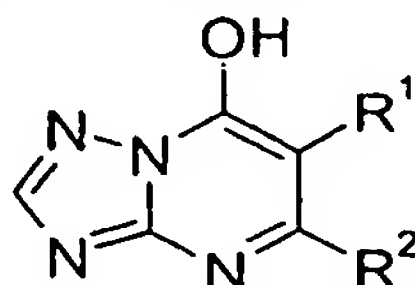
in der R für C₁-C₄-Alkyl steht, mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III

25



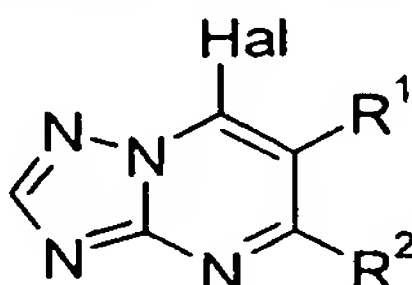
III

zu 7-Hydroxytriazolopyrimidinen der Formel IV



IV

umsetzt, welche zu Verbindungen der Formel V,



V

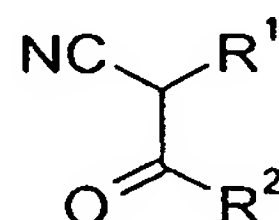
5

in der Hal für Chlor oder Brom steht, halogeniert werden, und V mit Ammoniak umgesetzt wird.

6. Verbindungen der Formel IV und V gemäß Anspruch 5.

10

7. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass man Acylcyanide der Formel VI,



VI

mit 3-Amino-1,2,4-triazol der Formel III gemäß Anspruch 5 umsetzt.

15

8. Fungizides Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Träger und eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4.

9. Saatgut, enthaltend eine Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 in einer Menge von 1 bis 1000 g pro 100 kg.

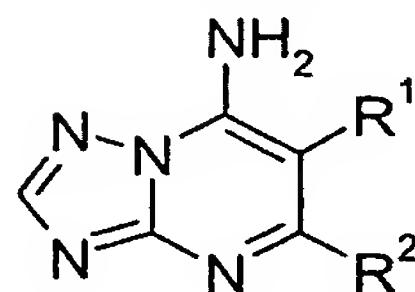
20

10. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, dass man die Pilze, oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 4 behandelt.

25

We claim:

1. A triazolopyrimidine of the formula I



5 in which the substituents are as defined below:

R^1 is C_5 - C_{12} -alkyl or C_5 - C_{14} -alkoxyalkyl, where the aliphatic groups may be substituted by 1 to 3 of the following groups:

10 cyano, nitro, hydroxyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_1 - C_6 -alkylthio, and NR^aR^b ;

R^a , R^b are hydrogen or C_1 - C_6 -alkyl;

15 R^2 is ethyl, $CH=CH_2$ or $CH_2CH=CH_2$.

2. The compound of the formula I according to claim 1, in which R^2 is ethyl.

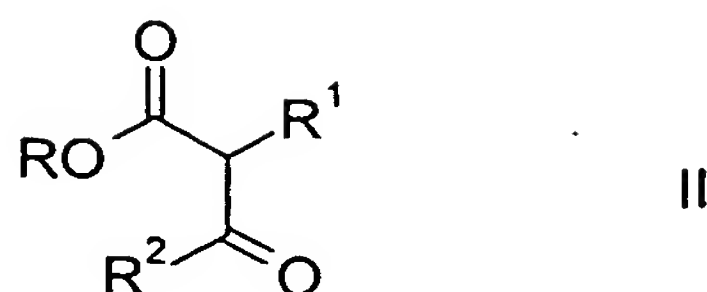
3. The compound of the formula I according to claim 1, in which R^1 is an
20 unsubstituted straight-chain or mono-, di- or tribranched alkyl chain having up to 12 carbon atoms.

4. Triazolopyrimidines of the formula I according to claim 1 selected from the group consisting of:

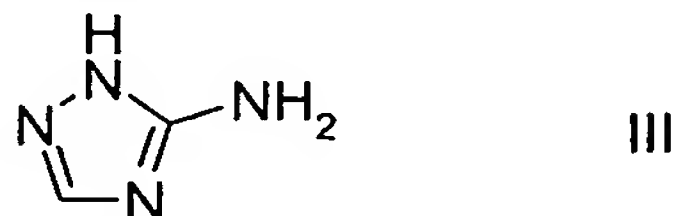
25 5-ethyl-6-(1-methylheptyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-ethyl-6-octyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-ethyl-6-(3,5,5-trimethylhexyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-ethyl-6-pentyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-ethyl-6-hexyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
30 5-ethyl-6-heptyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-ethyl-6-nonyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-ethyl-6-undecyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine;
5-ethyl-6-(3-pentyloxypropyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-ylamine.

- 35 5. A process for preparing compounds of the formula I according to any of claims 1 to 4 wherein β -keto esters of the formula II,

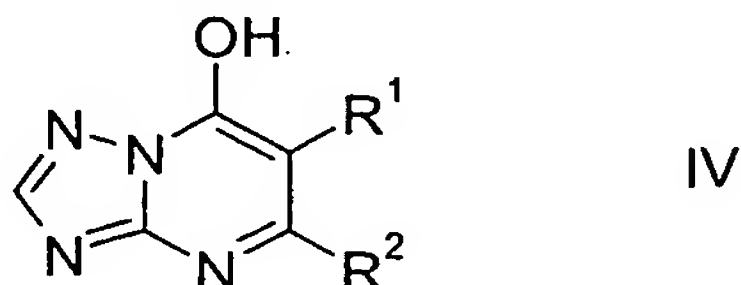
24



in which R is C₁-C₄-alkyl are reacted with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III

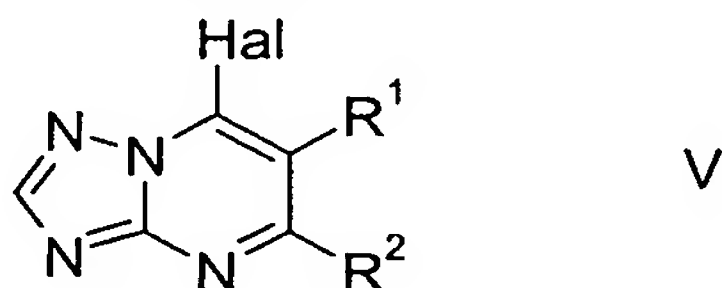


to give 7-hydroxytriazolopyrimidines of the formula IV



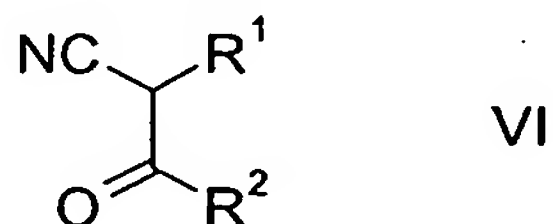
5

which are halogenated to give compounds of the formula V



in which Hal is chlorine or bromine and V is reacted with ammonia.

- 10 6. A compound of the formula IV or V according to claim 5.
7. A process for preparing compounds of the formula I according to any of claims 1 to 4 wherein acyl cyanides of the formula VI,



- 15 are reacted with 3-amino-1,2,4-triazole of the formula III according to claim 5.
8. A fungicidal composition comprising a solid or liquid carrier and a compound of the formula I according to any of claims 1 to 4.
- 20 9. Seed comprising a compound of the formula I according to any of claims 1 to 4 in an amount of 1 to 1000 g per 100 kg.
10. A method for controlling phytopathogenic harmful fungi, wherein the fungi or the materials, plants, the soil or seed to be protected against fungal attack are
- 25 treated with an effective amount of the compound of the formula I according to any of claims 1 to 4.